

**Disclaimer:**

This English translation is produced by machine translation and may contain errors. The JPO, the INPIT, and those who drafted this document in the original language are not responsible for the result of the translation.

**Notes:**

1. Untranslatable words are replaced with asterisks (\*\*\*\*).
2. Texts in the figures are not translated and shown as it is.

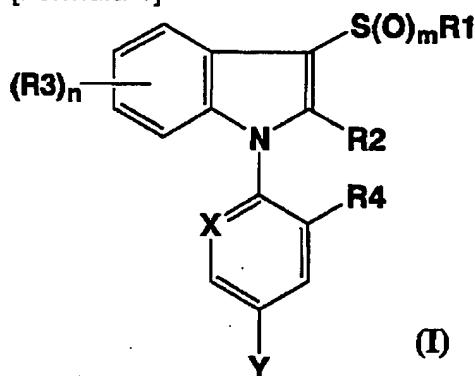
Translated: 07:10:18 JST 02/13/2008

Dictionary: Last updated 01/18/2008 / Priority: 1. Chemistry / 2. Biotechnology / 3. Industrial Products

---

**FULL CONTENTS**

---

**[Claim(s)]****[Claim 1] General formula (I)****[Formula 1]**

Among [type, X show CH, N, or C-halogen atom, and; Y A hydrogen atom, The C1-C5 alkyl group which may be replaced by the halogen atom, the C2-C5 alkenyl group which may be replaced by the halogen atom, The C2-C5 alkynyl group which may be replaced by the halogen atom, the C1-C5 alkoxy group which may be replaced by the halogen atom, A halogen atom, a cyano group, or a nitro group is shown, and; R1 shows the C1-C5 alkoxy group which may be replaced by the C1-C5 alkyl group or halogen atom which may be replaced by the halogen atom, and independently; R2, R3, and R4, respectively A hydrogen atom, The C1-C5 alkyl group which may be replaced by the halogen atom, the C2-C5 alkenyl group which may be replaced by the halogen atom, The C2-C5 alkynyl group, halogen atom which may be replaced by the halogen atom, A cyano group, a carboxyl group, the C1-C5 alkoxy carbonyl group that may be replaced by the halogen atom, The C1-C5 acyl group which may be replaced by the halogen atom, a nitro group, a cyanate group, a thio cyanate group, the C1-C5 alkoxy group that may be replaced by the halogen atom, or S(O) kR5 (k showing 0,

1, or 2 here) the C1-C5 alkyl group by which R5 may be replaced by the halogen atom -- being shown -- the flea controlling agent characterized by being shown, for; m showing 0, 1, or 2, and; n containing N displacement indole derivatives expressed with] which shows 1, 2, 3, or 4. [Claim 2] X of a general formula (I) -- N or C-halogen atom; -- C1-C by which Y may be replaced by the hydrogen atom and the halogen atom -- 5 alkyl group C1-C5 alkyl-group; R2 by which C1-C5 alkoxy group or halogen atom; R1 which may be replaced by the halogen atom may be replaced by the halogen atom, R3, and R4 independently, respectively A hydrogen atom, The C1-C5 alkyl group, halogen atom which may be replaced by the halogen atom, A carboxyl group, the C1-C5 alkoxy carbonyl group which may be replaced by the halogen atom, The flea controlling agent according to claim 1 0, 1, or whose 2; n C1-C5 alkoxy-group; m which may be replaced by the C1-C5 acyl group or halogen atom which may be replaced by the halogen atom is 1 or 2.

[Claim 3] C1-C3 alkyl-group; R2 by which C1-C3 alkyl-group; R1 by which N or C-Cl; Y is replaced for X of the general formula (I) by the halogen atom is replaced by the halogen atom, R3, and R4 independently, respectively A hydrogen atom, The flea controlling agent according to claim 1 0, 1, or whose 2; n C1-C3 alkyl-group or halogen atom; m which may be replaced by the halogen atom is 1.

[Claim 4] The compound of a general formula (I) 1-(3-chloro 5-trifluoro methylpyridine 2-IRU)-3-(dichloro fluoro methylthio) Indore, The flea controlling agent according to claim 1 which is 1-(2, 6-dichloro 4-trifluoro methylphenyl)-3-(dichloro fluoro methylthio) Indore or 1-(2, 6-dichloro 4-trifluoro methylphenyl)-3-(trifluoro methylthio) Indore.

[Claim 5] Claim 1 which is the flea to which the flea prevented is parasitic on a companion animal - a flea controlling agent given in any 1 clause of four.

[Claim 6] The shampoo agent for flea prevention of the breeding and extermination or rinse agent characterized by including the flea controlling agent of a description in Claim 1 - any 1 clause of five.

[Claim 7] Liquefaction drops for flea prevention of the breeding and extermination characterized by including the flea controlling agent of a description in Claim 1 - any 1 clause of five.

---

#### [Detailed Description of the Invention]

##### [0001]

[Field of the Invention] This invention relates to the flea controlling agent containing N displacement indole derivatives. Especially this controlling agent is applicable to extermination of the flea which is parasitic on companion animals, such as a dog and a cat.

[0002]

[Description of the Prior Art] Although medically important insect incidence rates, such as a fly, decreased sharply by the fast improvement of public health in recent years, the flea which is still parasitic on an animal especially humans, companion animals (a dog, a cat, etc.), etc. poses a problem. As the drugs for the prevention of the breeding and extermination An organic phosphorus system insecticide, the Cava mate system insecticide, a pyrethroid system insecticide, The drugs and the chloro nicotinyl system insecticide, for example, imidacloprid, called an IGR agent, The phenylpyrazole system insecticide (5-amino 1-(2, 6-dichloro 4-(trifluoromethyl) phenyl)-4-(trifluoromethyl) (sulfinyl)-1H-pyrazole 3-carbonitrile), for example, fipronil etc., is used.

[0003] On the other hand to a U.S. Pat. No. 3290332 gazette and JP,S55-151505,A, using N displacement indole derivatives as an antimicrobial agent is indicated. JP,H6-92935,A indicates N displacement indole derivatives about the use as insecticides, such as a cabbage moth and a planthopper. Moreover, in JP,2000-26409,A, although the heterocyclic substance of N-aryl / heteroaryl displacement is described, 3 place substituent of the Indole ring is only an annular substituent. Furthermore, using N displacement indole derivatives for a U.S. Pat. No. 5599774 gazette as a herbicide is indicated.

[0004]

[Problem(s) to be Solved by the Invention] The controlling agent of the flea which is parasitic on an animal cannot be said to be offering the safety based on sufficient selective toxicity to an application animal, and cannot necessarily be satisfied in the extermination effect and the field of an instantaneous effect. For example, fipronil is classified into the deleterious substance and we are anxious about the safety to an application animal. Moreover, when applying to a companion animal etc. by using N displacement indole derivatives as a flea controlling agent, user-friendly pharmaceutical preparation was not known, either.

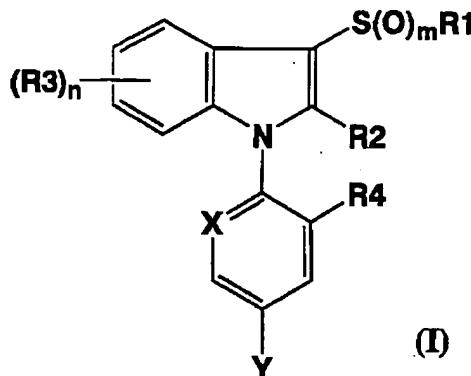
[0005]

[Means for Solving the Problem] Insect-killing activity [ as opposed to the flea of N displacement Indole compound in the bottoms of such a situation, and invention-in-this-application persons ], And as a result of repeating examination wholeheartedly about the safety to mammalian, insect-killing activity and an instantaneous effect with an expensive compound expressed with a general formula (I) were shown, and it found out further that toxicity was low to the mammals, and resulted in this invention.

[0006] That is, this invention is (1) general formula (I).

[0007]

[Formula 2]



[0008] Among [type, X show CH, N, or C-halogen atom, and;Y A hydrogen atom, The C1-C5 alkyl group which may be replaced by the halogen atom, the C2-C5 alkenyl group which may be replaced by the halogen atom, The C2-C5 alkynyl group which may be replaced by the halogen atom, the C1-C5 alkoxyl group which may be replaced by the halogen atom, A halogen atom, a cyano group, or a nitro group is shown, and;R1 shows the C1-C5 alkoxyl group which may be replaced by the C1-C5 alkyl group or halogen atom which may be replaced by the halogen atom, and independently;R2, R3, and R4, respectively A hydrogen atom, The C1-C5 alkyl group which may be replaced by the halogen atom, the C2-C5 alkenyl group which may be replaced by the halogen atom, The C2-C5 alkynyl group, halogen atom which may be replaced by the halogen atom, A cyano group, a carboxyl group, the C1-C5 alkoxy carbonyl group that may be replaced by the halogen atom, The C1-C5 acyl group which may be replaced by the halogen atom, a nitro group, a cyanate group, a thio cyanate group, the C1-C5 alkoxyl group that may be replaced by the halogen atom, or S(O) kR5 (k showing 0, 1, or 2 here) the C1-C5 alkyl group by which R5 may be replaced by the halogen atom -- being shown -- the flea controlling agent characterized by being shown, for;m showing 0, 1, or 2, and;n containing N displacement indole derivatives expressed with] which shows 1, 2, 3, or 4

[0009] (2) X of a general formula (I) -- N or C-halogen atom; -- Y -- a hydrogen atom -- The C1-C5 alkyl group which may be replaced by the halogen atom, the C1-C5 alkoxyl group which may be replaced by the halogen atom, Halogen atom; C1-C5 alkyl-group;R2 by which R1 may be replaced by the halogen atom, R3, and R4 independently, respectively A hydrogen atom, The C1-C5 alkyl group, halogen atom which may be replaced by the halogen atom, A carboxyl group, the C1-C5 alkoxy carbonyl group which may be replaced by the halogen atom, The flea controlling agent of the above-mentioned (1) description 0, 1, or whose 2;n C1-C5 alkoxyl-group;m which may be replaced by the C1-C5 acyl group which may be replaced by the halogen atom, and the halogen atom is 1 or 2 [0010] C1-C3 alkyl-group;R2 by which C1-C3 alkyl-group;R1 by which N or C-Cl;Y is replaced for X of the general formula (I) by the halogen atom is replaced by the halogen atom, R3, and R4 independently, respectively (3) A hydrogen atom, Even if replaced by the halogen atom Good C1-C3 alkyl group or a halogen atom; In m,

the compound of a flea controlling agent (4) general formula (I) given in 0, 1, or 2; above-mentioned [ above-mentioned n is 1 ] (1) 1-(3-chloro 5-trifluoro methylpyridine 2-IRU)-3-(dichloro fluoro methylthio) Indore, The flea controlling agent of the above-mentioned (1) description which is 1-(2, 6-dichloro 4-trifluoro methylphenyl)-3-(dichloro fluoro methylthio) Indore or 1-(2, 6-dichloro 4-trifluoro methylphenyl)-3-(trifluoro methylthio) Indore [0011] (5) The shampoo agent for flea prevention of the breeding and extermination characterized by the flea prevented containing the flea controlling agent of a description in any 1 clause of above-mentioned (1) controlling-agent [ flea ] (6) above-mentioned (1) - (5) given in any 1 clause of - (4) which is the flea which is parasitic on a companion animal Or it is related with the liquefaction drops for flea prevention of the breeding and extermination characterized by including the flea controlling agent of a description in any 1 clause of rinse agent (7) above-mentioned (1) - (5).

[0012]

[Embodiment of the Invention] In X of the above-mentioned general formula (I), CH, N, or C-halogen atom;Y the flea controlling agent of this invention A hydrogen atom, The C1-C5 alkyl group which may be replaced by the halogen atom, the C2-C5 alkenyl group which may be replaced by the halogen atom, The C2-C5 alkynyl group which may be replaced by the halogen atom, the C1-C5 alkoxy group which may be replaced by the halogen atom, C1-C5 alkoxy-group;R2 which may be replaced by the C1-C5 alkyl group or halogen atom by which halogen atom, cyano group, or nitro group;R1 may be replaced by the halogen atom, R3, and R4 independently, respectively A hydrogen atom, The C1-C5 alkyl group which may be replaced by the halogen atom, the C2-C5 alkenyl group which may be replaced by the halogen atom, The C2-C5 alkynyl group, halogen atom which may be replaced by the halogen atom, A cyano group, a carboxyl group, the C1-C5 alkoxy carbonyl group that may be replaced by the halogen atom, The C1-C5 acyl group which may be replaced by the halogen atom, a nitro group, a cyanate group, a thio cyanate group, the C1-C5 alkoxy group that may be replaced by the halogen atom, or S(O) kR5 (here, k is 0) 1 or 2 is shown and, as for R5,;m which shows the C1-C5 alkyl group which may be replaced by the halogen atom is characterized by 0, 1, or 2;n containing N displacement indole derivatives expressed with 1, 2, 3, or 4.

[0013] Although the halogen atom in this invention shows a fluorine atom, a chlorine atom, a bromine atom, and an iodine atom, a fluorine atom, a chlorine atom, or a bromine atom is desirable. Moreover, when two or more halogen atoms are included in a substituent, even if they are the same, they may differ. Although CH, N, or C-halogen atom is mentioned as X of the general formula (I) used for this invention, they are N or C-Cl especially preferably.

[0014] As C1-C5 alkyl group in Y of the general formula (I) used for this invention, the alkyl group of C1-C5 of a normal chain or branched chain is mentioned, and they are a methyl group, an ethyl group, a propyl group, an isopropyl group, butyl, tert-butyl, a pentyl machine,

etc. as an example. As an example of the C1-C5 alkyl group replaced by the halogen atom A chloromethyl machine, a dichloro methyl group, a fluoro methyl group, difluoromethyl group, a trifluoromethyl machine, a dichloro fluoro methyl group, a chlorodifluoromethyl group, a trichloromethyl machine, a pentafluoroethyl machine, etc. are mentioned.

[0015] As C2-C5 alkenyl group in Y of the general formula (I) used for this invention, for example, a vinyl group, An allyl group, an isopropenyl machine, a butenyl group, a pentenyl machine, etc. are mentioned. As C2-C5 alkenyl group replaced by the halogen atom, for example, a fluoro vinyl group, a chloro vinyl group, a bird chloro vinyl group, 3 and 3, 3-trifluoro propenyl machine, a 2-bromo 2-butenyl group, a perfluoro 2-methyl 2-pentenyl machine, etc. are mentioned. An ethynyl group, a propynyl machine, etc. are mentioned as C2-C5 alkynyl group in Y of the general formula (I) used for this invention, and for example, a chloro ethynyl group, a chloro propynyl machine, etc. are mentioned as C2-C5 alkynyl group replaced by the halogen atom.

[0016] As C1-C5 alkoxyl group in Y of the general formula (I) used for this invention The C1-C5 alkoxyl group of a normal chain or branched chain is mentioned, and a methoxy group, an ethoxy group, a propoxy group, an isopropoxy group, a butoxy machine, a tert-butoxy machine, etc. are mentioned as an example. As an example of the C1-C5 alkoxyl group replaced by the halogen atom, a chloro methoxy group, a bromo methoxy group, a dichloro fluoro methoxy group, a trifluoro methoxy group, a trifluoroethoxy machine, a pentafluoro ethoxy group, etc. are mentioned. The C1-C5 alkyl group which may be replaced by the hydrogen atom and the halogen atom preferably as Y of a general formula (I), It is the C1-C5 alkoxyl group or halogen atom which may be replaced by the halogen atom, and is the C1-C3 alkyl group which may be especially replaced by the halogen atom or the halogen atom preferably, and they are a chlorine atom, a bromine atom, or a trifluoromethyl machine still more preferably. The C1-C5 alkyl group replaced by the C1-C5 alkyl group and halogen atom in Above Y as C1-C5 alkyl group which may be replaced by the halogen atom in R1 of the general formula (I) used for this invention, and the same group are mentioned, and an example is also the same.

[0017] The C1-C5 alkoxyl group replaced by the C1-C5 alkoxyl group and halogen atom in Above Y as C1-C5 alkoxyl group which may be replaced by the halogen atom in R1 of the general formula (I) used for this invention, and the same group are mentioned, and an example is also the same. It is the C1-C5 alkyl group which may be replaced by the halogen atom preferably as R1 of a general formula (I). It is the C1-C3 alkyl group especially replaced by the halogen atom preferably, and they are specifically a trifluoromethyl machine, a dichloro fluoro methyl group, a chlorodifluoromethyl group, and a trichloromethyl machine.

[0018] As C1-C5 alkyl group which may be replaced by the halogen atom in R2 of the general formula (I) used for this invention, R3, and R4 The C1-C5 alkyl group replaced by the C1-C5

alkyl group and halogen atom in Above Y and the same group are mentioned, and an example is also the same. As C2-C5 alkenyl group which may be replaced by the halogen atom in R2 of the general formula (I) used for this invention, R3, and R4 The C2-C5 alkenyl group replaced by the C2-C5 alkenyl group and halogen atom in Above Y and the same group are mentioned, and an example is also the same. As C2-C5 alkynyl group which may be replaced by the halogen atom in R2 of the general formula (I) used for this invention, R3, and R4 The C2-C5 alkynyl group replaced by the C2-C5 alkynyl group and halogen atom in Above Y and the same group are mentioned, and an example is also the same.

[0019] As a C1-C5 alkoxy carbonyl group which may be replaced by the halogen atom in R2 of the general formula (I) used for this invention, R3, and R4 For example, a methoxycarbonyl group, an ethoxycarbonyl group, a propoxycarbonyl group, a butoxycarbonyl group, a tert-butoxycarbonyl group, 2 and 2, 2-trifluoro ethoxycarbonyl group, etc. are mentioned. As C1-C5 acyl group which may be replaced by the halogen atom in R2 of the general formula (I) used for this invention, R3, and R4 For example, a formyl group, an acetyl group, a propionyl group, a BUCHIRIRU group, an isobutyryl group, a valeryl group, a pivaloyl group, a trifluoroacetyl group, a trichloroacetyl group, 3 and 3, 3-trifluoro propionyl group, etc. are mentioned.

[0020] As C1-C5 alkoxy group which may be replaced by the halogen atom in R2 of the general formula (I) used for this invention, R3, and R4 The C1-C5 alkoxy group replaced by the C1-C5 alkoxy group and halogen atom in Above Y and the same group are mentioned, and an example is also the same. As C1-C5 alkyl group which may be replaced by the halogen atom in R of S(O) kR55 in R2 of the general formula (I) used for this invention, R3, and R4 The C1-C5 alkyl group replaced by the C1-C5 alkyl group and halogen atom in Above Y and the same group are mentioned, and an example is also the same. In addition, k can take 0, 1, or 2.

[0021] Preferably as R2 of a general formula (I), it is the C1-C5 alkyl group or halogen atom which is not replaced [ a hydrogen atom and ], and they are a hydrogen atom or a methyl group especially preferably.

[0022] It is the C1-C5 alkoxy group, halogen atom, and cyano group which may be replaced by the hydrogen atom and the halogen atom preferably as R3 of a general formula (I), and they are a hydrogen atom, a fluorine atom, a chlorine atom, a bromine atom, a methoxy group, and a cyano group especially preferably. Moreover, about the displacement position, the 4th place of the Indole ring, the 5th place, or the 6th place is desirable, and especially the 5th place is desirable in it.

[0023] It is the C1-C5 alkoxy group which may be replaced preferably as R4 of a general formula (I) by the C1-C5 alkyl group or halogen atom which may be replaced by the halogen atom and the halogen atom. They are a chlorine atom, a fluorine atom, a trifluoromethyl

machine, and a trifluoro methoxy group especially preferably. Although 0, 1, or 2 can be taken as m of the general formula (I) used for this invention, 0 or 2 is desirable. Although either 1, 2, 3 or 4 can be taken as n of the general formula (I) used for this invention, 1 or 2 is desirable and especially 1 is desirable.

[0024] As a compound of the general formula (I) used for the flea controlling agent of this invention 1-(3-chloro 5-trifluoro methylpyridine 2-IRU)-3-(dichloro fluoro methylthio) Indore, 1-(3-chloro 5-trifluoro methylpyridine 2-IRU)-3-(dichloro fluoro methylthio)-5-fluoro Indore, 1-(3-chloro 5-trifluoro methylpyridine 2-IRU)-3-(dichloro fluoro methylthio)-2-methylindole, 1-(2, 6-dichloro 4-trifluoro methylphenyl)-3-(dichloro fluoro methylthio) Indore, It is mentioned by 1-(2, 6-dichloro 4-trifluoro methylphenyl)-3-(trifluoro methylthio) Indore etc., and [ especially ] preferably 1-(3-chloro 5-trifluoro methylpyridine 2-IRU)-3-(dichloro fluoro methylthio) Indore, 1-(2, 6-dichloro 4-trifluoro methylphenyl)-3-(dichloro fluoro methylthio) Indore and 1-(2, 6-dichloro 4-trifluoro methylphenyl)-3-(trifluoro methylthio) Indore are mentioned.

[0025] In order to prevent a parasite simpler and effectively although only N displacement indole derivatives may be used as it is when using the compound of the above-mentioned general formula (I) as a flea controlling agent Liquefaction drops, liquids and solutions, a spray, foamy pharmaceutical preparation, a tablet, a granule, subtle granules, dust, It is desirable to medicate the whole application organism or a portion in the various modes permitted as \*\*\*\*\* such as directions in pharmaceutical forms, such as a capsule, injections, a suppository, and a chewable agent, directions mixed to a shampoo agent or a rinse agent, directions taught to the collar, and directions mixed with feed. Liquefaction drops, a shampoo agent, or especially a rinse agent is especially desirable.

[0026] For example, liquefaction drops are N displacement indole derivatives 0.1 - 20 weight parts and a glycol, or a liquefied skin administration agent that carries out glycol monoalkyl ether 10-95 weight part content, and can make other components contain suitably as occasion demands. As other components, for example, methanol, ethanol, isopropanol, The liquefied carrier with which it mixes with glycols, such as alcohols, such as tert-butanol and benzyl alcohol, propylene carbonate, a N-methyl-2-pyrrolidone, and water, or glycol monoalkyl ether easily is mentioned.

[0027] These liquefaction drops are usually applied to an animal by the partial processing methods, such as spot-on treatment or pore-on treatment, and, thereby, can prevent ectoparasite efficiently. By dropping a liquefied ectoparasite controlling agent at the skin of the scapula back of an animal body etc., the spot-on processing method is a method of preventing ectoparasite. The pore-on processing method is a method of preventing ectoparasite, when a liquefied ectoparasite controlling agent is poured out along the mid-dorsal line of an animal and this controlling agent spreads subsequently to a body surface. The amount of application to the animal of this controlling agent is usually 0.001ml/kg - 10ml/kg as a constituent, and is

0.1mg/kg - 3000mg/kg as an amount of N displacement indole derivatives.

[0028] Moreover, although a spray is a liquefied ectoparasite controlling agent which carries out 10-95 weight part content of N displacement indole derivatives 0.1 - 20 weight parts, glycols or glycol monoalkyl ether, alcohols, and the surface active agent, it may contain other components suitably as occasion demands, for example. for example, as glycols or glycol monoalkyl ether Diethylene glycol monoethyl ether, propylene glycol, etc. can be illustrated, and methanol, ethanol, isopropanol, tert-butanol, benzyl alcohol, etc. can be illustrated as alcohols. As a surface active agent, anion system surface active agents, such as higher alcohol sodium sulfate, stearyl methylanmonium chloride, polyoxyethylene alkyl phenyl ether, and lauryl betaine, a cation system surface active agent, and a zwitter ion system surface active agent are raised. The amount of application to the animal of this controlling agent is usually 0.1mg/kg - about 3000mg/kg per [ to apply ] animal and as a constituent as 0.01ml/kg - about 10ml [ kg ] /and an amount of N displacement indole derivatives.

[0029] N displacement indole derivatives can be subdivided suitably, it can mix with a diluent or Carrier, and a capsule, a pill, or the tablet can add disintegrator and/or binders, such as starch, lactose, a talc, and magnesium stearate, further, and can prepare them by tabletting if needed.

[0030] Although preparation as a sterile solution is required for injections, the sufficient salt or grape sugar for making isotonic use other substance, for example, the solution, as blood may be contained in this. [ usable liquid Carrier / ester /, such as glyceride, such as vegetable oils, such as sesame oil, and triacetin, benzyl benzoate, myristic acid isopropyl, and a fatty acid derivative of propylene glycol ] Organic solvents, such as pyrrolidone and a glycerol formal, are also contained. This pharmaceutical preparation is prepared by making it dissolve or suspend so that an active ingredient may be included 0.01 to 10weight % in the above-mentioned liquid carrier, for example.

[0031] Moreover, as a method of mixing and using it for a shampoo agent or a rinse agent, N displacement indole derivatives can be preferably included 0.1 to 2% in a commercial shampoo agent or a commercial rinse agent, and can also be prepared 0.01 to 10% to it. Moreover, the exclusive shampoo agent or rinse agent which consists of the component and N displacement indole derivatives of the shampoo agent usually used for animals or a rinse agent can also be prepared, and it is about 0.1 to 2% preferably about 0.01 to 10% as concentration of N displacement indole derivatives. Specifically, it is prepared, for example with N displacement indole derivatives, the solvent permitted, a solubilizing agent or an emulsifier, a detergent or a treatment agent, water, etc. Furthermore, an aromatic, a thickener or a viscosity modifier, a pH adjuster, etc. may also be included. As a solvent permitted, alcohols, such as a glycol or glycol monoalkyl ether, methanol, ethanol, isopropanol, tert-butanol, and benzyl alcohol, etc. are illustrated. Also about other pharmaceutical preparation,

the component needed for preparation of a constituent of the surface active agent generally known, a diluent, an additive, a stabilizer, etc. can be added and built.

[0032] Moreover, the flea controlling agent of this invention can also prescribe a medicine for the patient together with the food of an animal, therefore can also prepare the thing or premix added to the condensed food.

[0033] The flea controlling agent of this invention can also be mixed and used together with other insecticides, a nematicide, other \*\* flea agents, a synergist, etc. As these examples, for example Organic phosphorus system compounds, such as diazinon and DDVP (2 and 2-Dichlorovinyl-O, O-dimethylphosphate), The Cava mate system compounds, such as carbosulfan, cyclo pro thorin, ETOFEMPUOKUSU, Chloro nicotinyl system compounds, such as pyrethroid system compounds, such as allethrin and permethrin, and imidacloprid, Benzoyl urea system compounds, such as phenylpyrazole series compounds, such as fipronil, and RUFENURON, Juvenile hormone similar compounds, such as methoprene and pyriproxyfen, clo MAFENOJIDO, Use with macrolide system compounds, such as hydrazine system compounds, such as tebufenozone, milbemycin, IBERUME cutin, MOKISHIDE cutin, and SERAME cutin, other buprofezin, aza-DIRA cutin, etc. is mentioned.

[0034] Can carry out by the usual method currently performed in each pharmaceutical preparation about the medication method of the above-mentioned pharmaceutical preparation, and as the dose Especially if it is the quantity in which an effect is demonstrated by prevention of the breeding and extermination of a flea without a side reaction, it will not be limited, but it is usually 0.01mg/kg - about 3000mg/kg, is 0.1mg/kg - about 1500mg/kg preferably, and is 1mg/kg - about 500mg/kg especially preferably.

[0035] The active principle remains in effective amount for an administration living thing, and the intervals of administration of the flea controlling agent of this invention change with a living thing kind, a trial compound, and manufactured types of medicine that what is necessary is just to set up the target effect from the period which can be demonstrated enough. For example, in liquefaction drops, about, from one month, it is about one year, and preferably, from one month, intervals of administration are six months and are three months from one month especially preferably.

[0036] Especially if the flea which can apply the flea controlling agent of this invention is a flea which is parasitic on an animal, it will not be limited, but [ especially ] the flea which is parasitic on a companion animal is mentioned. They are specifically HITONOMI (Pulex irritans), a dog flea (Ctenocephalides canis), a cat flea (Ctenocephalides felis), a rat flea, etc. Companion animals (companion animal) are usually things bred at home, such as a dog, a cat, a hamster, and a rabbit.

[0037] Next, the example of representation of a compound expressed with the above-mentioned general formula (I) used for this invention is shown in Table 1.

[0038]

Table 1 NO.XYmR1R2R3R4 n 1NCF3 0CCI2F HHCl 1 2NCF3 0CCI2F H5-FCI 1 3NCF3 0CCI2F H5-Cl Cl 1 4NCF3 0CCI2F H5-Br Cl 1 5NCF3 0CCI2F H5-OCH3 Cl 1 6N CF3 0 CCI2F H 5-CN Cl 1 7 N CF3 0 CCI2F H 4-Cl Cl 1 8NCF3 0CCI2F H6-Cl Cl 1 9NCF3 0CF3HHCl 1 10NCF3 0CF3H5-Cl Cl 1 11NCF3 0CCI3 HHCl 1 12NCF3 0CCI3 H5-Cl Cl 1 13NCI0CCI2F HHCl 1 14 N CF3 0 CCI2F CH3 H Cl 1 15 N CF3 1 CCI2F H H Cl 1 16NCF3 2CCI2F HHCl 1 17CCI CF3 0CCI2F HHCl 1 18CCI CF3 0CCI2F H5-FCI 1 19CCI CF3 0CCI2F H5-Cl Cl 1 20CCI CF3 0CCI2F H5-Br Cl 1 21CCI CF3 0CCI2F H5-OCH3 Cl 1 22CCI CF3 0 CCI2F H 5-CN Cl 1 23 CCI CF3 0 CCI2F H 4-C I Cl 1 24CCI CF3 0CCI2F H6-Cl Cl 1 25CCI CF3 0CF3HHCl 1 26CCI CF3 0CF3H5-Cl Cl 1 27CCI CF3 0CCI3 HHCl 1 28CCI CF3 0CCI3 H5-Cl Cl 1 29CCI Cl0CCI2F HHCl 1 30 CCI CF3 0 CCI2F CH3 H Cl 1 31 CCI CF3 1 CCI2F H H Cl 1 32 CCI CF3 2 CCI2F H H Cl 1 [0039]

[Example] Although the extermination effect of a flea, the emulsion and liquefaction drops which used N displacement indole derivatives for below, and a shampoo agent and a rinse agent are shown as a work example, the invention in this application is not limited to this work example.

[0040] Work example 1 The mixture solution of an emulsion dimethyl sulfo KISASHIDO 85 weight part, a xylene 85 weight part, and the new cull gene 900 (made by Takemoto fats-and-oils company) 20 weight part was carried out. The amount part of compound 10 of No.17 of Table 1 or No.25 was mixed in this mixed solution 90 weight part, and it was considered as the emulsion.

[0041] Work example 2 The mixture solution of a liquefaction drops diethylene-glycol-monoethyl-ether 75 weight part and the ethanol 15 weight part was carried out. The amount part of compound 20 of No.17 or No.25 was mixed in this mixed solution 80 weight part, and it was considered as liquefaction drops 20%. Liquefaction drops were prepared 10% and 30% similarly.

[0042] Work example 3 The compound of No.25 of Table 1 is added to the shampoo for the object for dogs, or cats or rinse of a shampoo agent and rinse agent marketing 1%, and it fully agitates, and is made uniform. Thus, the shampoo agent for flea prevention of the breeding and extermination or the rinse agent for flea prevention of the breeding and extermination is obtained.

[0043] Work example 4 Effect (1) over the cat flea of N displacement indole derivatives Each compound was dissolved in the acetone solution so that it might become prescribed concentration, and the 0.1ml was dropped at the bottom of 2.8cm in diameter, and 12cm in height the glass inner tube, and it was air-dry. After air-drying, ten cat flea imagos were put into the glass inner tube, and it covered by the nylon mesh, and put gently under room temperature:26 degree C and a humidity:80% condition. Knockdown (KD) 3 hours after and

the life and death of 24 or 48 hours after were judged, and a knockdown rate and mortality were computed. A test result is shown in Table 2 about compound No.1 of Table 1, and 2, 3, 14, 17, 19, 25 and 32. Fipronil was used as positive control. It considered no drugs processing as control.

[0044]

Table 2 compound (mg/tube) 3 hours after (KD) One day after (mortality) Two days after (mortality)  
11801001000.101001000.010701000.00101040 2101001000.10 100 100 0.01 0 10  
50 0.00 1000 31050900.1040700.01010200.00102020 14101001000. 10 100 100 0.01 0 50  
100 0.001 02030 171501001000.101001000.010701000.00101040 19101001000.1060 100  
0.01 0 30 90 25 1 100 901000.1101001000.010701000.0010030 32101001000.  
10301000.010020 0.001 0 0 0 Fipronil 1 0 100 1000. 101001000.01020900.00102020 control-  
00 N displacement indole derivatives of zero compound No.1, No.17, and No.25 are the low concentration of 0.01mg, and are about 70% of the mortality of a cat flea in one day. Having been shown expresses the high insect-killing activity and the high instantaneous effect of N displacement indole derivatives.

[0045] Work example 5 Effect (2) over the cat flea of N displacement indole derivatives Compound No.17 and fipronil were dissolved so that it might become 10% to a liquefaction drops pharmaceutical preparation base material (mixed liquor of a diethylene-glycol-monoethyl-ether 75 weight part and an ethanol 15 weight part), and 0.5ml of the dissolution solution was dropped at the carapace part of the cat on which 30 cat fleas were made parasitic one day ago. Till dropping and 8 hours after, the flea which fell from the cat object top every 2 hours was counted, the accumulation fall rate was computed, the flea which fell 24 more hours afterward was counted, and the accumulation fall rate of an one day after was computed. Moreover, flea powder GUSHI was used two days after dropping, and the number of survival fleas on a cat object was counted. A test result is shown in Table 3.

[0046]

table 3 an accumulation fall rate (%)

Compound 2 hours after 4 hours after 6 hours after 8 hours after 17015 after 24 hours 37 47  
100 Fipronil 0 3 20 27 90 Compound No.17 are Flea from Cat Object Top in Fast-acting. The effect to drop was shown. In addition, the flea after fall died within several hours. Three fleas which died were accepted 24 hours afterward on the body of the cat which, on the other hand, trickled the fipronil used as control.

[0047] Work example 6 Effect (3) over the cat flea of N displacement indole derivatives

Compound No.17 were dissolved so that it might become 10% to a liquefaction drops pharmaceutical preparation base material (mixed liquor of a diethylene-glycol-monoethyl-ether 75 weight part and an ethanol 15 weight part), and 0.5ml of the dissolution solution was dropped at the carapace part of the cat. 30 cat flea imagos were made parasitic on a cat object

after dropping and a predetermined week. Flea powder GUSHI was used after parasitism on the 2nd, and the number of survival fleas on a cat object was counted. A test result is shown in Table 4.

[0048]

It is the number of survival fleas on the 2nd (animal) after the number of weeks 12468 parasitism after table 4 administration. 0 0 0 6 13 compound No.17 are until after four weeks. The flea was made to die completely, six animals were accepted six weeks afterward and survival of 13 fleas was accepted eight weeks afterward among 30 animals. That is, the residual effectiveness of No.17 was a \*\*\*\* and a long period of time about six weeks.

[0049] Example 1 of an examination The compound or fipronil of the toxicity test table 1 to the mouse of N displacement indole derivatives was dissolved in olive oil so that it might become prescribed concentration, and a medicine was directly prescribed for the patient into the stomach of a std:ddy system male mouse using the sonde. The administration dose was carried out in 30mg [ kg ] /and kg and 100mg /. Life and death were observed 3 hours after administration and 1, 7, and 14 days afterward. A test result is shown in Table 5 about compound No.14 of Table 1, and 17 and 25.

[0050]

Seven days after one day after 3 hours after a table 5 accumulation mortality (number-of-deaths and number of sample offerings) compound dose (mg/kg) 14 days after 14300/50/50/51000/50/50/50/5 17300/50/50/51000/50/50/5 25 30 0/5 0/5 0/5 0/5 100 0/5 0/5 0/5 0/5 fipronil 300/51/51/5 1/5 100 1/5 5/5 5/5 5/5 exam is that N displacement indole derivatives are low toxicity to a mouse. It is shown.

[0051] Example 2 of an examination Toxicity test compound No.17 to the cat of N displacement indole derivatives It dissolved so that it might become 10%, 20%, and 30% to a liquefaction drops pharmaceutical preparation base material (mixed liquor of a diethylene-glycol-monoethyl-ether 75 weight part and an ethanol 15 weight part), and 0.5ml spot-on dropping of the dissolution solution was carried out at the carapace part of the cat. The clinical symptoms of the cat were observed after dropping. A test result is shown in Table 6.

[0052]

20 views that table 6 compound dropping concentration (%) clinical-symptoms 1710 view was not accepted were not accepted. 30 The unusual view by spot-on dropping of 10 of compound No.17 in which the view was not accepted, and the solution for 20 or 30% liquefaction drops was not accepted, and the influence of drugs was not accepted. This shows that compound No.17 are low toxicity also to a cat.

[0053]

[Effect of the Invention] The flea controlling agent containing N displacement indole derivatives of this invention has an extermination effect by the flea which is parasitic on an animal, and

suggests that that an extermination effect strong against the cat flea which has extended the parasitism host especially besides the cat is shown these days has the extermination effect which was excellent in flea prevention of the breeding and extermination of a companion animal etc., and an instantaneous effect. The infection to animal bodies, such as illness which a flea mediates, occurs, and that an instantaneous effect is shown means hardships. Moreover, the flea controlling agent of this invention is equipped also with the high usefulness that it is low toxicity, to the mammals including a pet. Furthermore, a user-friendly flea controlling agent is offered by making it an emulsion, liquefaction drops, and a shampoo agent and a rinse agent.

---

---

[Translation done.]

(19)日本特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特願2003-146810

(P2003-146810A)

(43)公開日 平成15年5月21日 (2003.5.21)

(51)Int.Cl.<sup>7</sup>  
A 01 N 43/38  
43/40 101  
A 61 K 7/075  
7/08  
7/40

識別記号

F I  
A 01 N 43/38  
43/40  
A 61 K 7/075  
7/08  
7/40

テ-マコ-ト<sup>\*</sup>(参考)  
4 C 0 8 3  
1 0 1 M 4 H 0 1 1

審査請求 未請求 請求項の数7 O L (全10頁)

(21)出願番号 特願2002-253818(P2002-253818)

(22)出願日 平成14年8月30日 (2002.8.30)

(31)優先権主張番号 特願2001-265279(P2001-265279)

(32)優先日 平成13年9月3日 (2001.9.3)

(33)優先権主張国 日本 (JP)

(71)出願人 000004086

日本化薬株式会社  
東京都千代田区富士見1丁目11番2号

(72)発明者 田辺 知嗣

埼玉県春日部市柏壁東3-4-21-204

(72)発明者 堀田 博樹

埼玉県さいたま市上落合6-8-25

(72)発明者 戸谷 哲也

岐阜県岐阜市根野128-18

(72)発明者 細田 勝彦

埼玉県さいたま市蓮沼276-5

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 N置換インドール誘導体を含有するノミ防除剤

(57)【要約】

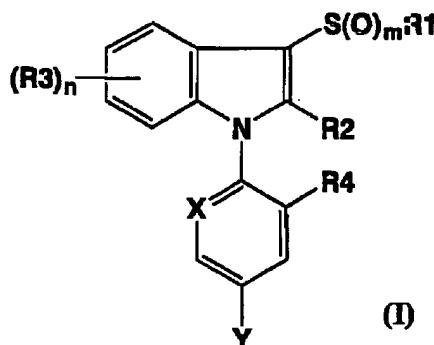
【課題】従来の動物に寄生するノミの防除剤は、適用生物に対して十分な選択性に基づく安全性を提供しているとは言えず、又その防除効果及び即効性の面に於いても必ずしも満足できるものではない。

【解決手段】N置換インドール化合物のノミに対する殺虫活性、及びペットを含む哺乳動物に対する安全性について銳意検討を重ねた結果、N置換インドール誘導体、例えば1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-(ジクロロフルオロメチルチオ)インドール、1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(ジクロロフルオロメチルチオ)インドール又は1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(トリフルオロメチルチオ)インドールが高い殺虫活性と即効性を示し、更にペットを含む哺乳類に対して毒性が低いことを見出した。

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項1】一般式(Ⅰ)

## 【化1】



【式中、XはCH、N又はC-ハロゲン原子を示し；Yは水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルキニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基、ハロゲン原子、シアノ基又はニトロ基を示し；R1はハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基又はハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基を示し；R2、R3及びR4はそれぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルキニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基、ハロゲン原子、シアノ基、カルボキシル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アシル基、ニトロ基、シアナト基、チオシアナト基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基又はS(O)<sub>k</sub>R5（ここで、kは0、1又は2を示し、R5はハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基を示す）を示し；mは0、1又は2を示し；nは1、2、3又は4を示す】で表されるN置換インドール誘導体を含有することを特徴とするノミ防除剤。

【請求項2】一般式(Ⅰ)のXがN又はC-ハロゲン原子；Yが水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基又はハロゲン原子；R1がハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基；R2、R3及びR4がそれぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基、ハロゲン原子、カルボキシル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アシル基又はハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基；mが0、1又は2；nが1又は2である請求項1記載のノミ防除剤。

【請求項3】一般式(Ⅰ)のXがN又はC-Cl；Yがハロゲ

ン原子で置換されているC1-C3アルキル基；R1がハロゲン原子で置換されているC1-C3アルキル基；R2、R3及びR4がそれぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C3アルキル基又はハロゲン原子；mが0、1又は2；nが1である請求項1記載のノミ防除剤。

【請求項4】一般式(Ⅰ)の化合物が1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-(ジクロロフルオロメチルチオ)インドール、1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(ジクロロフルオロメチルチオ)インドール又は1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(トリフルオロメチルチオ)インドールである請求項1記載のノミ防除剤。

【請求項5】防除されるノミが伴侶動物に寄生するノミである請求項1～4のいずれか1項に記載のノミ防除剤。

【請求項6】請求項1～5のいずれか1項に記載のノミ防除剤を含むことを特徴とするノミ防除用シャンプー剤又はリンス剤。

【請求項7】請求項1～5のいずれか1項に記載のノミ防除剤を含むことを特徴とするノミ防除用液化滴剤。

## 【発明の詳細な説明】

## 【0001】

【発明の属する技術分野】本発明はN置換インドール誘導体を含有するノミ防除剤に関する。本防除剤は特にイヌ、ネコ等の伴侶動物に寄生するノミの駆除に利用することができる。

## 【0002】

【従来の技術】近年、公衆衛生の飛躍的な改善によりハエ等の衛生害虫発生率が大幅に減少したものの、依然として動物、特にヒト、伴侶動物（イヌ、ネコ等）等に寄生するノミが問題となっている。その防除のための薬剤として、有機リン系殺虫剤、カーバメート系殺虫剤、ピレスロイド系殺虫剤、IGR剤と呼ばれる薬剤、クロロニコチニル系殺虫剤例えはイミダクロブリド、フェニルピラゾール系殺虫剤例えはフィプロニル（5-アミノ-1-(2,6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)-4-(トリフルオロメチル)スルフィニル)-1H-ピラゾール-3-カルボニトリル）等が使用されている。

【0003】一方、米国特許第3290332号公報及び特開昭55-151505号公報には、N置換インドール誘導体を抗歯剤として用いることが記載されている。特開平6-92935号公報には、N置換インドール誘導体をコナガ、ウンカ等の殺虫剤としての使用について記載されている。又、特開2000-26409号公報においては、N-アリール/ヘテロアリール置換の複素環物質が記述されているが、インドール環の3位置換基は環状置換基のみである。更に、米国特許第5599774号公報には、N置換インドール誘導体を除草剤として用いることが記載されている。

## 【0004】

【発明が解決しようとする課題】動物に寄生するノミの防除剤は、適用動物に対して十分な選択性に基づく安全性を提供しているとは言えず、その防除効果及び即効性の面に於いても必ずしも満足できるものではない。例えばフィプロニルは劇物に分類されており、適用動物に対する安全性が懸念される。又、N置換インドール誘導体をノミ防除剤として伴侶動物等に適用する際に使い勝手のよい製剤も知られていなかった。

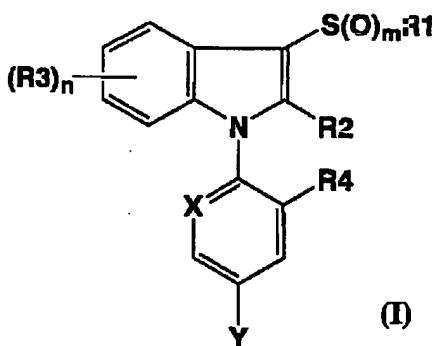
## 【0005】

【課題を解決するための手段】このような状況下、本願発明者らはN置換インドール化合物のノミに対する殺虫活性、及び哺乳動物に対する安全性について鋭意検討を重ねた結果、一般式(I)で表される化合物が高い殺虫活性と即効性を示し、更に哺乳類に対して毒性が低いことを見出し、本発明に至った。

【0006】即ち、本発明は、(1)一般式(I)

【0007】

【化2】



【0008】[式中、XはCH、N又はC-ハロゲン原子を示し；Yは水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルキニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基、ハロゲン原子、シアノ基又はニトロ基を示し；R1はハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基又はハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基を示し；R2、R3及びR4はそれぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルキニル基、ハロゲン原子、シアノ基、カルボキシル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アシル基、ニトロ基、シアナト基、チオシアナト基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基又はS(O)<sub>k</sub>R5(ここで、kは0、1又は2を示し、R5はハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基を示す)を示し；mは0、1又は2を示し；nは1、2、3又は4を示す]で表されるN置換インドール誘導体を含有することを特徴とするノミ防除剤

【0009】(2)一般式(I)のXがN又はC-ハロゲン原子；Yが水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基、ハロゲン原子；R1がハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基；R2、R3及びR4がそれぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基、ハロゲン原子、カルボキシル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アシル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基；mが0、1又は2；nが1又は2である上記(1)記載のノミ防除剤

【0010】(3)一般式(I)のXがN又はC-C1；Yがハロゲン原子で置換されているC1-C3アルキル基；R1がハロゲン原子で置換されているC1-C3アルキル基；R2、R3及びR4がそれぞれ独立に水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C3アルキル基又はハロゲン原子；mが0、1又は2；nが1である上記(1)記載のノミ防除剤

(4)一般式(I)の化合物が1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-(ジクロロフルオロメチルチオ)インドール、1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(ジクロロフルオロメチルチオ)インドール又は1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(トリフルオロメチルチオ)インドールである上記(1)記載のノミ防除剤

【0011】(5)防除されるノミが伴侶動物に寄生するノミである上記(1)～(4)のいずれか1項に記載のノミ防除剤

(6)上記(1)～(5)のいずれか1項に記載のノミ防除剤を含むことを特徴とするノミ防除用シャンプー剤又はリンス剤

(7)上記(1)～(5)のいずれか1項に記載のノミ防除剤を含むことを特徴とするノミ防除用液化滴剤に関する。

## 【0012】

【発明の実施の形態】本発明のノミ防除剤は、上記一般式(I)のXがCH、N又はC-ハロゲン原子；Yが水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルキニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基、ハロゲン原子、シアノ基又はニトロ基；R1がハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基又はハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基；R2、R3及びR4がそれぞれ独立に水

素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルケニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルキニル基、ハロゲン原子、シアノ基、カルボキシル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アシル基、ニトロ基、シアナト基、チオシアナト基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基又はS(0)<sub>k</sub>R<sub>5</sub>（ここで、kは0、1又は2を示し、R<sub>5</sub>はハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基を示す）；nが0、1又は2；nが1、2、3又は4で表されるN置換インドール誘導体を含有することを特徴とする。

【0013】本発明におけるハロゲン原子とはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子を示すが、フッ素原子、塩素原子又は臭素原子が好ましい。又、複数のハロゲン原子を置換基に含む場合には、それらは同一でも異なっていてもよい。本発明に使用される一般式（I）のXとしては、CH、N又はC-ハロゲン原子が挙げられるが、特に好ましくは、N又はC-Clである。

【0014】本発明に使用される一般式（I）のYにおけるC1-C5アルキル基としては、直鎖又は分岐鎖のC1-C5のアルキル基が挙げられ、具体例としては例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基等である。ハロゲン原子で置換されているC1-C5アルキル基の具体例としては、クロロメチル基、ジクロロメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、ジクロロフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、トリクロロメチル基、ペンタフルオロエチル基等が挙げられる。

【0015】本発明に使用される一般式（I）のYにおけるC2-C5アルケニル基としては例えばビニル基、アリル基、イソプロペニル基、ブテニル基、ペンテニル基等が挙げられ、ハロゲン原子で置換されているC2-C5アルケニル基としては例えばフルオロビニル基、クロロビニル基、トリクロロビニル基、3,3,3-トリフルオロプロペニル基、2-ブロモ-2-ブテニル基、パーフルオロ-2-メチル-2-ペンテニル基等が挙げられる。本発明に使用される一般式（I）のYにおけるC2-C5アルキニル基としては例えばエチニル基、プロピニル基等が挙げられ、ハロゲン原子で置換されているC2-C5アルキニル基としては例えばクロロエチニル基、クロロプロピニル基等が挙げられる。

【0016】本発明に使用される一般式（I）のYにおけるC1-C5アルコキシル基としては、直鎖又は分岐鎖のC1-C5アルコキシル基が挙げられ、具体例としては、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基及びtert-ブトキシ基等が挙げられる。ハロゲン原子で置換されているC1-C5アルコキシル基の

具体例としてはクロロメトキシ基、プロモメトキシ基、ジクロロフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基等が挙げられる。一般式（I）のYとして好ましくは、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基又はハロゲン原子であり、特に好ましくはハロゲン原子又はハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C3アルキル基であり、更に好ましくは、塩素原子、臭素原子又はトリフルオロメチル基である。本発明に使用される一般式（I）のR1におけるハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基としては、上記YにおけるC1-C5アルキル基及びハロゲン原子で置換されているC1-C5アルキル基と同様な基が挙げられ、具体例も同様である。

【0017】本発明に使用される一般式（I）のR1におけるハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシル基としては、上記YにおけるC1-C5アルコキシル基及びハロゲン原子で置換されているC1-C5アルコキシル基と同様な基が挙げられ、具体例も同様である。一般式（I）のR1として好ましくは、ハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基であり、特に好ましくはハロゲン原子で置換されているC1-C3アルキル基であり、具体的にはトリフルオロメチル基、ジクロロフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、トリクロロメチル基である。

【0018】本発明に使用される一般式（I）のR2、R3及びR4におけるハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルキル基としては、上記YにおけるC1-C5アルキル基及びハロゲン原子で置換されているC1-C5アルキル基と同様な基が挙げられ、具体例も同様である。本発明に使用される一般式（I）のR2、R3及びR4におけるハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルケニル基としては、上記YにおけるC2-C5アルケニル基及びハロゲン原子で置換されているC2-C5アルケニル基と同様な基が挙げられ、具体例も同様である。本発明に使用される一般式（I）のR2、R3及びR4におけるハロゲン原子で置換されていてもよいC2-C5アルキニル基としては、上記YにおけるC2-C5アルキニル基及びハロゲン原子で置換されているC2-C5アルキニル基と同様な基が挙げられ、具体例も同様である。

【0019】本発明に使用される一般式（I）のR2、R3及びR4におけるハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アルコキシカルボニル基としては、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、2,2,2-トリフルオロエトキシカルボニル基等が挙げられる。本発明に使用される一般式（I）のR2、R3及びR4におけるハロゲン原子で置換されていてもよいC1-C5アシル基としては、例えばホルミル基、アセチル

基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル基、ビバロイル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、3,3,3-トリフルオロプロピオニル基等が挙げられる。

【0020】本発明に使用される一般式(I)のR<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>及びR<sub>4</sub>におけるハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルコキシル基としては、上記YにおけるC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルコキシル基及びハロゲン原子で置換されているC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルコキシル基と同様な基が挙げられ、具体例も同様である。本発明に使用される一般式(I)のR<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>及びR<sub>4</sub>においてS(O)<sub>k</sub>R<sub>5</sub>におけるハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキル基としては、上記YにおけるC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキル基及びハロゲン原子で置換されているC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキル基と同様な基が挙げられ、具体例も同様である。なお、kは0、1又は2を取り得る。

【0021】一般式(I)のR<sub>2</sub>として好ましくは、水素原子、無置換のC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキル基又はハロゲン原子であり、特に好ましくは水素原子又はメチル基である。

【0022】一般式(I)のR<sub>3</sub>として好ましくは、水素原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルコキシル基、ハロゲン原子、シアノ基であり、特に好ましくは水素原子、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メトキシ基、シアノ基である。又その置換位置についてはインドール環の4位、5位又は6位が好ましく、その中で5位が特に好ましい。

【0023】一般式(I)のR<sub>4</sub>として好ましくは、ハロゲン原子、ハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルキル基又はハロゲン原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>アルコキシル基であり、特に好ましくは塩素原子、フッ素原子、トリフルオロメチル基、トリフルオロメトキシ基である。本発明に使用される一般式(I)のmとしては0、1又は2を取り得るが、0又は2が好ましい。本発明に使用される一般式(I)のnとしては1、2、3又は4のいずれかを取り得るが、1又は2が好ましく、特に1が好ましい。

【0024】本発明のノミ防除剤に使用される一般式(I)の化合物としては、1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-(ジクロロフルオロメチルチオ)インドール、1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-(ジクロロフルオロメチルチオ)-5-フルオロインドール、1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-(ジクロロフルオロメチルチオ)-2-メチルインドール、1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(ジクロロフルオロメチルチオ)インドール、1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(トリフルオロメチルチオ)インドール等が挙げられ、特に好ましくは、1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-(ジクロロフルオロメチルチオ)インドール、1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(ジクロロフルオロメチルチオ)インドール、1-(2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-3-(トリフルオロメチルチオ)インドールが挙げられる。

【0025】上記一般式(I)の化合物をノミ防除剤として用いる場合、N置換インドール誘導体のみをそのまま用いてもよいが、寄生虫をより簡便且つ効果的に防除するために、液化滴剤、液剤、噴霧剤、泡状製剤、錠剤、顆粒剤、細粒剤、粉剤、カプセル剤、注射剤、座剤、チュアブル剤等の剤型での使用法、シャンプー剤やリンス剤に混合しての使用法、首輪に仕込んだ使用法、飼料と混合しての使用法等殺寄生虫剤として許容される多様な態様で、適用生物体の全体又は部分へ投与することが好ましい。中でも液化滴剤、シャンプー剤又はリンス剤が特に好ましい。

【0026】例えば液化滴剤は、N置換インドール誘導体0.1~20重量部及び、グリコール又はグリコールモノアルキルエーテル10~95重量部含有する液状の皮膚投与剤であり、必要により適宜他の成分を含有させることができる。他の成分としては例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、tert-ブタノール、ベンジルアルコール等のアルコール類、炭酸プロピレン、N-メチル-2-ピロリドン、水等のグリコール又はグリコールモノアルキルエーテルと容易に混和する液状担体が挙げられる。

【0027】該液化滴剤は通常スポットオン処理又はボアオン処理等の局所処理法により動物へ適用され、これにより外部寄生虫を効率的に防除することができる。スポットオン処理法は動物体の肩甲骨背部の皮膚等に液状の外部寄生虫防除剤を滴下することにより、外部寄生虫を防除する方法である。ボアオン処理法は動物の背中線に沿って液状の外部寄生虫防除剤を注ぎ、次いで本防除剤が体表に広がることにより、外部寄生虫を防除する方法である。本防除剤の動物への適用量は例えば、組成物として通常0.001ml/kg~10ml/kgであり、N置換インドール誘導体量としては0.1mg/kg~3000mg/kgである。

【0028】又、例えば噴霧剤は、N置換インドール誘導体0.1~20重量部、グリコール類又はグリコールモノアルキルエーテル類、アルコール類及び界面活性剤を10~95重量部含有する液状の外部寄生虫防除剤であるが、必要により適宜、他の成分を含有し得る。例えば、グリコール類又はグリコールモノアルキルエーテル類としては、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、プロピレングリコール等を例示することができ、アルコール類としては、メタノール、エタノール、イソプロパノール、tert-ブタノール、ベンジルアルコール等を例示することができる。界面活性剤としては、高級アルコール硫酸ナトリウム、ステアリルメチルアンモニウムクロラウム、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、

ラウリルベタイン等の陰イオン系界面活性剤、陽イオン系界面活性剤、両性イオン系界面活性剤があげられる。本防除剤の動物への施用量は適用する動物あたり、組成物として通常0.01ml/kg～10ml/kg程度、N置換インドール誘導体量として、0.1mg/kg～3000mg/kg程度である。

【0029】カプセル剤、丸剤又は錠剤は、N置換インドール誘導体を適当に小分けし、希釈剤又はキャリアーと混合し、更に澱粉、乳糖、タルク、ステアリン酸マグネシウム等のような崩壊剤及び／又は結合剤を加え、必要に応じて打錠することによって調製可能である。

【0030】注射剤は、無菌溶液としての調製が必要であるが、これには他の物質、例えばその溶液を血液と等張にさせるのに十分な塩又はブドウ糖が含まれていてもよい。使用可能な液体キャリアーには、ごま油等の植物油、トリアセチン等のようなグリセリド、安息香酸ベンジル、ミリスチン酸イソプロピル及びプロピレンジリコールの脂肪酸誘導体等のようなエステルと共に、ピロリドン、グリセロールホルマール等のような有機溶媒も含まれる。この製剤は上記液体キャリアー中に活性成分を例えば0.01～10重量%含むように、溶解又は懸濁させることによって調製される。

【0031】又、シャンプー剤又はリンス剤に混合して使用する方法としては、市販のシャンプー剤又はリンス剤にN置換インドール誘導体を0.01～10%、好ましくは0.1～2%含ませて調製することもできる。又、動物用に通常用いられるシャンプー剤又はリンス剤の成分とN置換インドール誘導体からなる専用シャンプー剤又はリンス剤を調製することもでき、N置換インドール誘導体の濃度としては、0.01～10%程度、好ましくは0.1～2%程度である。具体的には、例えばN置換インドール誘導体、許容される溶媒、溶解補助剤又は乳化剤、洗剤又はトリートメント剤、水等により調製される。更に、芳香剤、増粘剤又は粘度調節剤、pH調整剤等を含んでもよい。許容される溶媒として、グリコール又はグリコールモノアルキルエーテル類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、tert-ブタノール、ベンジルアルコール等のアルコール類等が例示される。その他の製剤についても、一般的に知られている界面活性剤、希釈剤、添加剤、安定剤等の、組成物の調製に必要とされる成分を加えてつくることができる。

【0032】又、本発明のノミ防除剤は動物の餌と一緒に投与することも可能で、そのため濃縮した餌へ添加

表1

NO.	X	Y	■	R1	R2	R3	R4	n
1	N	CF <sub>3</sub>	0	CC12F	H	H	C1	1
2	N	CF <sub>3</sub>	0	CC12F	H	5-F	C1	1
3	N	CF <sub>3</sub>	0	CC12F	H	5-C1	C1	1
4	N	CF <sub>3</sub>	0	CC12F	H	5-Br	C1	1
5	N	CF <sub>3</sub>	0	CC12F	H	5-OCH <sub>3</sub>	C1	1
6	N	CF <sub>3</sub>	0	CC12F	H	5-CN	C1	1

した物又はプレミックスを調製することもできる。

【0033】本発明のノミ防除剤は他の殺虫剤、殺線虫剤、他の殺ノミ剤、更には共力剤等と混合・併用することもできる。これらの例としては、例えばダイアジノンやDDVP (2,2-Dichlorovinyl-0,0-dimethylphosphate) 等の有機リン系化合物、カルボスルファン等のカーバメート系化合物、シクロプロトリン、エトフェンプロクス、アレスリン、パーメスリン等のピレスロイド系化合物、イミダクロプリド等のクロロニコチニル系化合物、フィプロニル等のフェニルピラゾール系化合物、ルフェヌロン等のベンゾイルウレア系化合物、メトブレン、ピリプロキシフェン等の幼若ホルモン類似化合物、クロマフェノジド、テブフェノジド等のヒドラジン系化合物、ミルベマイシン、イベルメクチン、モキシテクチン、セラメクチン等のマクロライド系化合物、その他プロフェシン、アザディラクチン等との使用が挙げられる。

【0034】上記製剤の投与方法については、各々の製剤において行われている通常の方法にて実施することができ、その投与量としては、副作用なくノミの防除に効果が発揮される量であれば特に限定されないが、通常0.01mg/kg～3000mg/kg程度であり、好ましくは0.1mg/kg～1500mg/kg程度であり、特に好ましくは1mg/kg～500mg/kg程度である。

【0035】本発明のノミ防除剤の投与間隔は、その有効成分が投与生物に有効量残留し、目的とする効果を十分発揮できる期間から設定すればよく、生物種、試用化合物、製剤型によって異なる。例えば液化滴剤ではおおよそ投与間隔は1ヶ月から1年程であり、好ましくは1ヶ月から6ヶ月であり、特に好ましくは1ヶ月から3ヶ月である。

【0036】本発明のノミ防除剤の適用できるノミは、動物に寄生するノミであれば特に限定されないが、特に伴侶動物に寄生するノミが挙げられる。具体的にはヒトノミ (Pulex irritans)、イヌノミ (Ctenocephalides canis)、ネコノミ (Ctenocephalides felis)、ネズミノミ等である。伴侶動物 (コンパニオンアニマル) とは、通常、家庭で飼育されるイヌ、ネコ、ハムスター、うさぎ等のことである。

【0037】次に本発明に使用される上記一般式 (I) で表される化合物の代表例を表1に示す。

【0038】

7	N	CF3	0	CC12F	H	4-C1	C1	1
8	N	CF3	0	CC12F	H	6-C1	C1	1
9	N	CF3	0	CF3	H	H	C1	1
10	N	CF3	0	CF3	H	5-C1	C1	1
11	N	CF3	0	CC13	H	H	C1	1
12	N	CF3	0	CC13	H	5-C1	C1	1
13	N	C1	0	CC12F	H	H	C1	1
14	N	CF3	0	CC12F	CH3	H	C1	1
15	N	CF3	1	CC12F	H	H	C1	1
16	N	CF3	2	CC12F	H	H	C1	1
17	CC1	CF3	0	CC12F	H	H	C1	1
18	CC1	CF3	0	CC12F	H	5-F	C1	1
19	CC1	CF3	0	CC12F	H	5-C1	C1	1
20	CC1	CF3	0	CC12F	H	5-Br	C1	1
21	CC1	CF3	0	CC12F	H	5-OCH3	C1	1
22	CC1	CF3	0	CC12F	H	5-CN	C1	1
23	CC1	CF3	0	CC12F	H	4-C1	C1	1
24	CC1	CF3	0	CC12F	H	6-C1	C1	1
25	CC1	CF3	0	CF3	H	H	C1	1
26	CC1	CF3	0	CF3	H	5-C1	C1	1
27	CC1	CF3	0	CC13	H	H	C1	1
28	CC1	CF3	0	CC13	H	5-C1	C1	1
29	CC1	C1	0	CC12F	H	H	C1	1
30	CC1	CF3	0	CC12F	CH3	H	C1	1
31	CC1	CF3	1	CC12F	H	H	C1	1
32	CC1	CF3	2	CC12F	H	H	C1	1

## 【0039】

【実施例】以下にN置換インドール誘導体を用いたノミの防除効果と乳剤、液化滴剤、シャンプー剤・リンス剤を実施例として示すが、本願発明はこの実施例に限定されるものではない。

## 【0040】実施例1 乳剤

ジメチルスルホキサンド85重量部、キシレン85重量部、ニューカルゲン900（竹本油脂社製）20重量部を混合溶解した。この混合溶液90重量部に表1のNo.17又はNo.25の化合物10重量部を混合し乳剤とした。

## 【0041】実施例2 液化滴剤

ジエチレングリコールモノエチルエーテル75重量部、エタノール15重量部を混合溶解した。この混合溶液80重量部にNo.17又はNo.25の化合物20重量部を混合し20%液化滴剤とした。同様に10%、30%液化滴剤も調製された。

## 【0042】実施例3 シャンプー剤・リンス剤

表2

化合物	(mg/tube)	3時間後 (K.D.)	1日後(死亡率)	2日後(死亡率)
1	1	80	100	100
	0.1	0	100	100
	0.01	0	70	100
	0.001	0	10	40

市販のイヌ用又はネコ用シャンプー又はリンスに表1のNo.25の化合物を1%加え、十分に攪拌し均一にする。このようにしてノミ防除用シャンプー剤又はノミ防除用リンス剤を得る。

## 【0043】実施例4 N置換インドール誘導体のネコノミに対する効果(1)

各化合物を所定濃度になるようにアセトン溶液に溶解し、その0.1mlを直径2.8cm、高さ12cmのガラスチューブの底に滴下し、風乾した。風乾後、ネコノミ成虫10匹をガラスチューブに入れナイロンメッシュで蓋をし、室温:26°C、湿度:80%条件下に静置した。3時間後のノックダウン(K.D.)及び24、48時間後の生死を判定し、ノックダウン率、死虫率を算出した。表1の化合物No.1、2、3、14、17、19、25及び32について試験結果を表2に示す。フィプロニルをポジティブコントロールとして用いた。薬剤無処理を対照とした。

## 【0044】

2	1	0	100	100
	0.1	0	100	100
	0.01	0	10	50
	0.001	0	0	0
3	1	0	50	90
	0.1	0	40	70
	0.01	0	10	20
	0.001	0	20	20
14	1	0	100	100
	0.1	0	100	100
	0.01	0	50	100
	0.001	0	20	30
17	1	50	100	100
	0.1	0	100	100
	0.01	0	70	100
	0.001	0	10	40
19	1	0	100	100
	0.1	0	60	100
	0.01	0	30	90
25	1	100	90	100
	0.1	10	100	100
	0.01	0	70	100
	0.001	0	0	30
32	1	0	100	100
	0.1	0	30	100
	0.01	0	0	20
	0.001	0	0	0
フィプロニル	1	0	100	100
	0.1	0	100	100
	0.01	0	20	90
	0.001	0	20	20
対照	-	0	0	0

化合物No.1、No.17及びNo.25のN置換インドール誘導体は、0.01mgという低濃度で1日後にはネコノミの死亡率70%を示したことは、N置換インドール誘導体の高い殺虫活性と即効性を表している。

#### 【0045】実施例5 N置換インドール誘導体のネコノミに対する効果（2）

化合物No.17及びフィプロニルを液化滴剤製剤基材（ジエチレングリコールモノエチルエーテル75重量部とエタノール15重量部の混合液）に10%になるように溶解し、

1日前にネコノミ30匹を寄生させたネコの背甲部にその溶解溶液を0.5ml滴下した。滴下後、8時間後までは2時間毎にネコ体上より落下したノミを数え累積落下率を算出し、更に24時間後に落下したノミを数え1日後までの累積落下率を算出した。又、滴下2日後にノミ取りグシを用いてネコ体上の生存ノミ数を数えた。試験結果を表3に示す。

#### 【0046】

表3

化合物	2時間後	4時間後	累積落下率(%)		
			6時間後	8時間後	24時間後
17	0	15	37	47	100
フィブロニル	0	3	20	27	90

化合物No.17は、速効的にネコ体上よりノミを落下させる効力を示した。なお、落下後のノミは数時間以内に死滅した。一方、対照として用いたフィブロニルを滴下したネコの体上に24時間後、3匹の死滅したノミが認められた。

【0047】実施例6 N置換インドール誘導体のネコノミに対する効果(3)

化合物No.17を液化滴剤製剤基材(ジエチレングリコールモノエチルエーテル75重量部とエタノール15重量部の

混合液)に10%になるように溶解し、ネコの背甲部にその溶解溶液を0.5ml滴下した。滴下後、所定時間にネコノミ成虫30匹をネコ体上に寄生させた。寄生後2日目にノミ取りグシを用いてネコ体上の生存ノミ数を数えた。試験結果を表4に示す。

【0048】

表4

投与後の週間数	1	2	4	6	8
寄生後2日目の生存ノミ数(匹)	0	0	6	13	
	0	0	6	13	

化合物No.17は4週間後までノミを完全に死滅させ、6週間後に30匹中6匹、8週間後に13匹のノミの生存が認められた。即ち、No.17の残効性は6週間程度あり、長期間であった。

【0049】試験例1 N置換インドール誘導体のマウスに対する毒性試験

表1の化合物又はフィブロニルをオリーブ油に所定濃度

表5

化合物	投与量(mg/kg)	累積死亡率(死亡数・供試数)			
		3時間後	1日後	7日後	14日後
14	30	0/5	0/5	0/5	0/5
	100	0/5	0/5	0/5	0/5
17	30	0/5	0/5	0/5	0/5
	100	0/5	0/5	0/5	0/5
25	30	0/5	0/5	0/5	0/5
	100	0/5	0/5	0/5	0/5
フィブロニル	30	0/5	1/5	1/5	1/5
	100	1/5	5/5	5/5	5/5

本試験は、N置換インドール誘導体がマウスに対し低毒性であることを示している。

【0051】試験例2 N置換インドール誘導体のネコに対する毒性試験

化合物No.17を液化滴剤製剤基材(ジエチレングリコールモノエチルエーテル75重量部とエタノール15重量部の

混合液)に10%、20%、30%になるように溶解し、ネコの背甲部にその溶解溶液を0.5mlスポットオン滴下した。滴下後、ネコの臨床症状を観察した。試験結果を表6に示す。

【0052】

表6

化合物	滴下濃度(%)	臨床症状		
		所見は認められなかった	所見は認められなかった	所見は認められなかった
17	10			
	20			
	30			

化合物No.17の10、20、30%液化滴剤用溶液のスポットオン滴下による異常所見は認められず、薬剤の影響は認められなかった。このことは、化合物No.17がネコに対しても低毒性であることを示している。

【0053】

【発明の効果】本発明のN置換インドール誘導体を含有するノミ防除剤は、動物に寄生するノミに防除効果を有し、特に最近、ネコ以外にも寄生宿主を広げているネコ

ノミに強い防除効果を示すことは伴侶動物等のノミ防除において優れた防除効果と即効性を持つことを示唆する。即効性を示すことは、ノミが仲介する病気等の動物体への感染が起き辛いことを意味する。又、本発明のノミ防除剤はペットを含む哺乳類に対し低毒性であるという高い有用性も備えている。更に、乳剤、液化滴剤やシャンプー剤・リンス剤にすることにより使い勝手のよいノミ防除剤を提供する。

---

フロントページの続き

F ターム(参考) 4C083 AA122 AC032 AC102 AC172  
AC402 AC762 AC851 AC852  
BB53 CC38 CC39 DD23 DD27  
DD31 EE10 EE21 EE50 FF01  
4H011 AC02 BA01 BB09 BC01 BC03  
BC07 DA16 DC05 DD05 DD07